

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 2002-012539

(43)Date of publication of application : 15.01.2002

(51)Int.Cl.

A61K 9/08
A61K 7/00
A61K 7/48
A61K 31/17
A61K 47/02
A61K 47/10
A61K 47/12
A61K 47/26
A61P 17/16

(21)Application number : 2000-193935

(71)Applicant : RU MIKKU KENKYUSHO:KK

(22)Date of filing : 28.06.2000

(72)Inventor : MATSUSHITA YOSHIHIRO

(54) WATER-BASED LIQUID AGENT FOR EXTERNAL USE

(57)Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a water-based liquid agent for external use presenting a keratolytic action and a moisture-retaining action owing to urea and good in sense of use.

SOLUTION: This water-based liquid agent is prepared by blending urea, a polyhydric alcohol, a water-soluble calcium salt and a bamboo extract solution in water.

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2002-12539

(P2002-12539A)

(43) 公開日 平成14年1月15日 (2002.1.15)

(51) Int.Cl. ⁷	識別記号	F I A 61 K 9/08 7/00	ナーマード(参考) 4 C 0 7 6 C 4 C 0 8 3 B 4 C 2 0 6 K F
---------------------------	------	----------------------------	--

審査請求 未請求 請求項の数 5 O L (全 4 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2000-193935(P2000-193935)	(71) 出願人	500304637 株式会社ル・ミック研究所 大阪市港区夕凪1丁目15-30 ナイキビル 2階
(22) 出願日	平成12年6月28日 (2000.6.28)	(72) 発明者	松下 良博 大阪市港区夕凪1丁目15-30 ナイキビル 2階 株式会社ル・ミック研究所内
		(74) 代理人	100074332 弁理士 藤本 界 (外1名)
			最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 水性外用液剤

(57) 【要約】

【課題】 尿素によって角質溶解作用、保湿作用を呈すると共に、使用感の良好な水性外用液剤を提供することを課題とする。

【解決手段】 水に、尿素、多価アルコール、水溶性のカルシウム塩、竹類抽出液が配合されてなることを特徴とする水性外用液剤に係る。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 水に、尿素、多価アルコール、水溶性のカルシウム塩、竹類抽出液が配合されてなることを特徴とする水性外用液剤。

【請求項2】 有機酸及び有機酸アンモニウムが配合されてなる請求項1記載の水性外用液剤。

【請求項3】 オオバクエキス及びヒノキチオールの少なくとも何れか一方が配合されてなる請求項1又は2記載の水性外用液剤。

【請求項4】 トレハロースが配合されてなる請求項1乃至3の何れかに記載の水性外用液剤。

【請求項5】 pHが4.5～7.0である請求項1乃至4の何れかに記載の水性外用液剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、化粧品、医薬部外品、医薬品等として使用される水性外用液剤に関し、特に、水に尿素が配合されてなる水性外用液剤に関する。

【0002】

【従来の技術】一般に、尿素は、皮膚の古い角質をとる角質溶解作用、角質の水分保持力を高める保湿作用を呈するとともに、僅かながら抗菌性を有することが知られており、従来、老人乾皮症、アトピー皮膚等の皮膚疾患用の水性外用液剤に含有される有効成分として、広く使用されている。

【0003】近年においては、その角質溶解作用や保湿作用から化粧水や医薬部外品等の水性外用液剤の有効成分としても広く使用されている。

【0004】また、グリセリン、プロビレングリコール等の多価アルコールは、尿素の保湿作用を助長する性質があることから、尿素と共に有効成分として上記水性外用液剤に配合されている。

【0005】

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、上記の如く、尿素及び多価アルコールが水に配合された水性外用液剤は、尿素の呈する保湿作用から、皮膚に塗布した後、長時間に亘ってべとつき感が残り、使用感の好ましくないものであった。

【0006】しかも、尿素は、水と長期間共存すると加水分解されてアミノニアを発生し、水性外用液剤のpH値の上昇を引き起こすが、このような尿素の加水分解によってpH値の上昇した水性外用液剤を皮膚に塗布すると、皮膚のアルカリ中和能に障害を与えたり、皮膚の細菌汚染を促進する等の問題が発生する虞もある。即ち、尿素が配合された水性外用液剤は、長期間を経た場合にはpHの上昇によって使用することができず、長期間保存の効かない、所謂経時安定性の不十分なものであつた。

【0007】そこで、本発明は、上記従来の問題点に鑑みかねわからぬ、尿素によって角質溶解作用、保湿作

用を呈すると共に、使用感の良好な水性外用液剤を提供することを第一の課題とし、更に、経時安定性も良好な水性外用液剤を提供することを第二の課題とするものである。

【0008】

【課題を解決するための手段】本発明者は、上記第一の課題を解決すべく、観察検討した結果、カルシウムイオン化して水中に溶けだした所謂カルシウム含有活性液は、水分子同士の水素結合が切断されて、通常の水よりも極めて粘度の低いものとなる点に着目すると共に、竹類抽出液が水中に溶けたカルシウムイオンをイオン状態で安定化させることを見出し、本発明を完成するに至った。

【0009】即ち、本発明は、水に、尿素、多価アルコール、水溶性のカルシウム塩、竹類抽出液が配合されてなることを特徴とする水性外用液剤に係る。

【0010】本発明においては、その作用は明らかでないが、水溶性のカルシウム塩が水に溶けだしてカルシウムイオンとなり、該カルシウムイオンが竹類抽出液によってイオン状態で安定化すると共に水のクラスターを小さくすることにより、液剤のべとつきが抑制され、使用感が改善されるものと考えられる。尚、竹類抽出液がカルシウムイオンを安定化する作用については、竹抽出液が通常酸性（一般的にはpH3.0前後）を呈するにも関わらず、極めて低い酸化還元電位を示すという特性から、還元性を呈し、該還元性によってカルシウムイオンが安定化するものと考えられる。

【0011】

【発明の実施の形態】本発明において、尿素の配合量は、水性外用液剤100mlに対して、1g～5gが好ましい。また、多価アルコールとしては、グリセリン、プロビレングリコール、ポリエチレングリコール等を表示することができる。特に、表示指定成分の觀点から、グリセリンが好ましい。多価アルコールの配合量としては、水性外用液剤100mlに対して、0.1ml～0.9mlが好ましい。

【0012】水溶性のカルシウム塩としては、塩化カルシウムが好ましく、特に、二水和物の塩化カルシウムが好ましい。塩化カルシウムの配合量としては、無水物相当量が水性外用液剤100mlに対して、10～50mgが好ましい。

【0013】また、本発明において、竹類抽出液とは、竹類から抽出されたエキスのことと、例えば、竹類を圧搾することにより、又、竹類を粉碎し、水やアルコール等の溶媒で加热抽出することにより得ることができるものである。この竹類抽出液の配合量は、竹類を圧搾した圧搾液相当量、水性外用液剤100mlに対して0.01～0.09mlが好ましく、固形分相当量（液体分を完全に蒸発させた状態とした場合に相当する量）で、水性外用液剤100mlに対して0.2～4.5mg

が好ましい。固形分相当量は、竹類抽出液を水浴上で略完全に蒸発させた後、100°Cで3時間乾燥させ、その重さを測定することにより得られる値である。尚、竹類としては、孟宗竹、真竹、淡竹等を使用できる。

【0014】更に、本発明においては、有機酸及び有機酸アンモニウムが配合されてなるものが好ましい。有機酸及び有機酸アンモニウムは、緩衝溶液として作用すると共に共通イオン効果によって尿素の分解を抑制するところから、有機酸及び有機酸アンモニウムが配合されてなれば、アンモニアの発生によるpHの上昇を抑制し、絶対安定性に優れらるもの、即ち、上記第二の課題を解決するものとなる。しかも、竹類抽出液は、pH値の上昇に伴ってオリの発生原因となる（その理由は定かでない。）が、有機酸及び有機酸アンモニウムの配合によって、pH値の上昇が抑制されることから、オリの発生も抑制され、商品価値が急激に減少することも防止できる。

【0015】有機酸としては、乳酸、クエン酸、酒石酸等を例示でき、配合量としては、水性外用液剤100mlに対して、0.1～0.09mlが好ましい。

【0016】有機酸アンモニウムとしては、酒石酸アンモニウム、クエン酸水素二アンモニウム等を例示でき、中でもクエン酸水素二アンモニウムが好ましい。クエン酸水素二アンモニウムを使用した場合、配合量としては、水性外用液剤100mlに対して、0.1～0.9gが好ましい。

【0017】特に、有機酸として乳酸、有機酸アンモニウムとしてクエン酸二水素アンモニウムの組み合わせが好ましく、この場合の配合量としては、水性外用液剤100mlに対して、乳酸0.03～0.07ml、クエン酸二水素アンモニウム0.4～0.6g、即ち、乳酸0.03～0.07%（V/V）、クエン酸二水素アンモニウム0.4～0.6%（W/V）が好ましい。係る範囲の配合量であれば、長期間pH値を4.5以上7.0以下に保つことができ、より長期間使用できるものとなる。また、pHが8.0以上に上昇することにより、竹抽出液の成分の何らかの変化により、水性外用液剤中にオリが発生することになるが、上記配合量とすることにより、長期間（228日以上）pH値を7.0以下に維持することができ、水性外用液剤中のオリの発生を抑制して、オリの発生による商品価値の低下を抑制することができる。

【0018】本発明においては、更に、オオバクエキス及びヒノキチオールの少なくとも何れか一方が配合されなるものが好ましい。オオバクエキス及びヒノキチオールは、本来抗菌性を備えた成分であり、防腐効果を奏することから、これらの成分が配合されることにより、水性外用液剤が長期間腐り難くなる。これらの成分の配合量としては、オオバクエキスの場合、水性外用液剤100mlに対して0.1～0.8mlが解き1.4%（V/V）に保

キチオールの場合、水性外用液剤100mlに対して1.1～1.9mgが好ましい。

【0019】また、本発明においては、更に、トレハロースが配合されてなるものが好ましい。トレハロースは保湿性に優れることから、このようなトレハロースを配合することにより、尿素の配合量を多くすることなく、水性外用液剤の保湿性を一層高めることができる。トレハロースの配合量としては、水性外用液剤100mlに対して0.5～1.5gが好ましい。

【0020】更に、本発明においては、pHが4.5～7.0の範囲であるものが好ましい。かかる範囲であれば、カルシウムイオンが十分にイオン状態で維持されると共に、オリの発生によって水性外用液剤が濁る虞もなく、濁ることによって商品価値が低減する虞も減少する。

【0021】

【実施例】実施例1

尿素3g、グリセリン0.5ml、オオバクエキス（商品名「オオバクリキッドE」、一丸ファルコス株式会社製）0.4ml、ヒノキチオール（商品名「ヒノキチオール」、高砂香料株式会社製）1.5mg、トレハロース1g、クエン酸水素二アンモニウム0.5g、乳酸0.05ml、N.I.C溶液（株式会社ルミック研究所製）1mlに精製水を加えて100mlの溶液を調製し、実施例1の水性外用液剤とした。ここで、N.I.C溶液とは、二水塩化カルシウム5g及び竹抽出液5mlに、イオン交換水を加えて溶かし100mlとした液で、該竹抽出液は、京都・弥栄産の竹粉500gに水4000mlを加え380°Cまで加熱（圧力約2MPa）した後、冷却し、上澄み液2000mlを抽出したものである。尚、水を蒸発させて固形分量を測定したところ、竹抽出液5mlには、固形分が175mg含まれていた。

【0022】実施例2

クエン酸二水素アンモニウムを1gとした以外は、実施例1と同様の方法により実施例2の水性外用液剤を調製した。

【0023】実施例3

クエン酸二水素アンモニウムを0.2gとした以外は、実施例1と同様の方法により実施例3の水性外用液剤を調製した。

【0024】実施例4

クエン酸二水素アンモニウムを0.1gとした以外は、実施例1と同様の方法により実施例4の水性外用液剤を調製した。

【0025】実施例5

クエン酸二水素アンモニウムを無配合とした以外は、実施例1と同様の方法により実施例5の水性外用液剤を調製した。

【0026】試験例

各実施例で調製した水性外用液剤をそれぞれ40°Cに保

ち、調製直後、6日後、10日後、14日後、17日後、24日後、31日後、38日後におけるpHを測定した。測定結果を表1に示す。

【0027】

【表1】

pH測定結果 (40°C保存)		毎日(日)							
クエン酸アノニウム 濃度(重量%)		0日	6日	10日	14日	17日	24日	31日	38日
0	3.40	4.58	5.14	6.84	/10	7.92	8.34	8.57	
0.1	4.10	4.9	5.37	6.29	6.69	7.31	/96	8.14	
0.2	4.40	4.81	5.31	5.85	6.28	7.10	8.06	8.17	
0.5	4.78	5.07	5.20	5.39	5.50	5.84	6.11	6.53	
1	4.92	5.08	5.12	5.21	5.26	5.43	5.63	5.79	

【0028】表1から明らかな様に、クエン酸水素二アンモニウム塩の配合により、調製直後のpH値を強い酸性域から中性域側に移動できること、更には、経時変化、即ちその後のpHの上昇も抑制できることが分かる。特に、乳酸0.05% (V/V)、クエン酸水素二アンモニウムを0.5% (W/V) 配合すると、調製直後から38日後ものであっても人の肌に対して好適に使用できるpH域（一般に、4.5～7.0（特に4.5～6.5）前後が好ましいとされている。）を維持で

き、この結果から、厚生省の加速試験の基準によれば、調製直後から228日間は人の肌に好適なpH域で使用できることが分かる。

【0029】

【発明の効果】以上のように、本発明の水性外用液剤は、配合された尿素、多価アルコールによって角質溶解作用、保湿作用を呈すると共に、水溶性カルシウム塩、竹類抽出液によって、べたつきが少なく使用感が良好であるという効果を奏する。

フロントページの続き

(51) Int.Cl.7	識別記号	F I	(参考)
A 6 1 K 7/48		A 6 1 K 7/48	
31/17		31/17	
47/02		47/02	
47/10		47/10	
47/12		47/12	
47/26		47/26	
A 6 1 P 17/16		A 6 1 P 17/16	
F ターム(参考) 4C076 AA12 BB31 CC18 DD23 DD38 DD41 DD43 DD54 DD67 EE53 EE58 FF36			
4C083 AA111 AA112 AB051 AB341 AB342 AC111 AC122 AC231 AC302 AC681 AC682 AD191 AD192 AD551 AD552 CC02 DD23 DD27 EE01 EE12			
4C206 AA01 AA02 HA27 MA03 MA05 MA37 MA83 NA03 ZA89			